

УТВЕРЖДЕНО
Приказ Министерства
здравоохранения Украины
01.02.13 № 77
Регистрационное удостоверение
№ UA/12713/01/01

ИНСТРУКЦИЯ
для медицинского применения препарата
ЛИДОКАИН
(LIDOCAINE)

Состав:

действующее вещество: lidocaine;

1 мл раствора содержит лидокаина гидрохлорида 20 мг;

вспомогательные вещества: натрия хлорид, натрия гидроксид 1 М раствор, вода для инъекций.

Лекарственная форма. Раствор для инъекций.

Фармакотерапевтическая группа. Препараты для местной анестезии. Лидокаин.
Код АТС N01B B02.

Клинические характеристики.

Показания. Местная анестезия (терминальная, инфильтрационная, проводниковая) в хирургии, стоматологии, офтальмологии, оториноларингологии; блокада периферических нервов и нервных сплетений при разных болевых синдромах.

Противопоказания. Повышенная индивидуальная чувствительность к компонентам препарата, другим амидным местноанестезирующим средствам, наличие в анамнезе эпилептиформных судорог на лидокаин, тяжелая брадикардия, тяжелая артериальная гипотензия, кардиогенный шок, тяжелые формы хронической сердечной недостаточности (II-III степени), синдром слабости синусового узла, синдром Вольфа-Паркинсона-Уайта, синдром Адамса-Стокса, атриовентрикулярная (AV) блокада II и III степени, гиповолемия, тяжелые нарушения функции печени/почек, порфирия, миастения, ретробульбарное введение больным глаукомой.

Способ применения и дозы. Препарат применяют инъекционно (подкожно, внутримышечно) и местно на слизистые оболочки. Следует избегать внутрисосудистого введения препарата. Перед применением препарата обязательным является проведение кожной пробы на повышенную чувствительность к лидокаину, о чем свидетельствуют отек и покраснение в месте инъекции.

Для терминальной анестезии слизистые оболочки взрослым смазывают препаратом в дозе до 2 мг/кг лидокаина, длительность анестезии – 15-30 минут. Максимальная доза препарата для взрослых – 20 мл.

Для проводниковой анестезии (в т. ч. для обезболивания плечевого и крестцового сплетений) вводят 5-10 мл (100-200 мг лидокаина) препарата, *для анестезии пальцев конечностей, носа, ушей* – 2-3 мл (40-60 мг) препарата. Максимальная доза препарата для взрослых – 10 мл (200 мг).

Для анестезии в офтальмологии по 2 капли препарата инстиллируют в конъюнктивальный мешок 2-3 раза с интервалом 30-60 секунд непосредственно перед исследованием или хирургическим вмешательством.

Детям в возрасте от 12 лет при всех видах периферического обезболивания общая доза лидокаина не должна превышать 3 мг/кг массы тела.

Для всех видов инъекционного обезболивания возможно сочетание лидокаина с эpineфрином (1:50000, 1:100000; готовят ex tempore, добавляют 1 каплю 0,1 % раствора эpineфрина на 5-10 мл раствора лидокаина 2 %), за исключением случаев, когда системное действие, которое оказывает эpineфрин (адреналин), нежелательно – повышенная чувствительность к эpineфрину, артериальная гипертензия, сахарный диабет, глаукома или необходимо кратковременное анестезирующее действие. Эpineфрин способствует замедлению всасывания лидокаина, пролонгирует его действие.

Побочные реакции. *Со стороны нервной системы:* возбуждение центральной нервной системы (ЦНС) (при применении в высоких дозах), беспокойство, головная боль, головокружение, нарушение сна, спутанность сознания, сонливость, потеря сознания, кома, нарушение чувствительности, онемения языка и губ (при применении в стоматологии), моторный блок; у пациентов с повышенной чувствительностью – эйфория, тремор, тризм, двигательное беспокойство, парестезии, судороги.

Со стороны органов зрения: нистагм, обратимая слепота, диплопия, мигание «мушек» перед глазами, светобоязнь, конъюнктивит.

Со стороны органов слуха: слуховые нарушения, шум в ушах, гиперacusия.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: при применении в высоких дозах – аритмия, брадикардия, замедление проводимости сердца, поперечная блокада сердца, остановка сердечной деятельности, периферическая вазодилатация, коллапс; очень редко – тахикардия, повышение/снижение артериального давления, боль в сердце.

Со стороны системы пищеварения: тошнота, рвота.

Со стороны дыхательной системы: одышка, ринит, угнетение или остановка дыхания.

Аллергические реакции: крайне редко – кожные высыпания, крапивница, зуд, генерализованный эксфолиативный дерматит, ангионевротический отек, анафилактические реакции (в т. ч. анафилактический шок).

Другие: ощущение жара, холода или онемения конечностей, отеки, слабость, злокачественная гипертермия.

Местные реакции: ощущение легкого жжения, которое исчезает с возрастанием анестезирующего эффекта (в течение 1 мин), гиперемия. При спинальной или эпидуральной анестезии может наблюдаться боль в спине, ногах, частичная/полная спинномозговая блокада, которая сопровождается снижением артериального давления, нарушением дефекации, произвольным мочеиспусканием, импотенцией, потерей чувствительности в области промежности (вероятность этих эффектов растет при применении высших доз или при случайном введении лидокаина в спинномозговое пространство, когда доза, предназначенная для введения в эпидуральное пространство, попадает в спинномозговое пространство); в отдельных случаях после такого вмешательства возобновление двигательной, сенсорной и/или вегетативной функции происходит медленно (через несколько месяцев) или в неполной мере.

Передозировка. Возможно усиление побочных реакций.

Симптомы: психомоторное возбуждение, головокружение, общая слабость, снижение артериального давления, тремор, нарушение зрения, тонико-клонические судороги, кома, коллапс, AV-блокада, асфиксия, апноэ. Первые симптомы передозировки у здоровых добровольцев возникают при концентрации лидокаина в крови больше 0,006 мг/кг, судороги – при 0,01 мг/кг.

Лечение: прекращение введения препарата, оксигенотерапия, противосудорожные средства, вазоконстрикторы (норадреналин, мезатон), холинолитики. Пациент должен находиться в горизонтальном положении; необходимо обеспечить доступ свежего воздуха, подачу кислорода и/или проведение искусственного дыхания. Симптомы со стороны ЦНС корректируются применением бензодиазепинов/барбитуратов кратковременного действия. Если передозировка возникает в процессе анестезии, следует применить кратковременный миорелаксант. Для коррекции брадикардии и нарушений проводимости применяют атропин (0,5-1 мг внутривенно), при артериальной гипотензии – симпатомиметики в комбинации с агонистами β-адренорецепторов. При остановке сердца

показано немедленное проведение реанимационных мероприятий. Возможно проведение интубации, искусственной вентиляции легких. В острой фазе передозировки диализ неэффективен. Специфического антидота нет.

Применение в период беременности или кормления грудью. В период беременности препарат противопоказан. При необходимости применения препарата кормление грудью следует прекратить.

Дети. Препарат применяют детям в возрасте от 12 лет.

Особенности применения. Введения лидокаина могут осуществлять только медицинские работники.

При обработке места инъекции дезинфицирующими веществами, которые содержат тяжелые металлы, повышается риск развития местной реакции в виде болезненности и отека.

Во время применения лидокаина обязательным является контроль ЭКГ. В случае нарушений деятельности синусового узла, удлинения интервала P-Q, расширением QRS или при развитии новой аритмии следует уменьшить дозу/отменить препарат.

Перед применением лидокаина при заболеваниях сердца (гипокалиемия снижает эффективность лидокаина) необходимо нормализовать уровень калия в крови.

Перед введением лидокаина в высоких дозах рекомендуется назначение барбитуратов. При проведении планируемой субарахноидальной анестезии необходимо отменить ингибиторы МАО не позже чем за 10 дней до проведения анестезии.

Следует соблюдать осторожность во избежание случайного интравазального (особенно при проведении местной анестезии в области, содержащие много кровеносных сосудов) или субдурального введения препарата. Необходимо установить пристальный контроль за системным токсичным действием препарата на сердечно-сосудистую и центральную нервную системы (поскольку дозы, предназначенные для эпидуральной анестезии, всегда более высокие, чем для субдуральной); при введении в васкуляризированные ткани рекомендуется проводить аспирационную пробу.

Чрезвычайную осторожность следует соблюдать при анестезии вокруг позвоночного отдела у больных с неврологическими заболеваниями, деформацией позвоночника, септицемией.

Меньшие дозы препарата следует вводить в участок головы и шеи, включая ретробульбарное и стоматологическое введение, а также применение для блокады звездчатого ганглия, поскольку системные токсичные эффекты препарата через ретроградный поток могут проникнуть в мозговое кровообращение.

Чрезвычайную осторожность следует соблюдать при ретробульбарном введении, поскольку возможны тяжелые побочные эффекты: коллапс, одышка, судороги, обратимая слепота.

Поскольку лидокаин оказывает выраженное антиаритмическое действие и может сам выступать в качестве аритмогенного фактора, который может повлечь развитие аритмии, перед введением препарата необходимо собрать анамнез относительно наличия признаков аритмии и с осторожностью применять препарат лицам с жалобами на аритмии в прошлом.

С осторожностью и в меньших дозах применяют пациентам с сердечной недостаточностью умеренной степени, артериальной гипотензией умеренной степени, неполной АВ-блокадой, нарушениями внутрижелудочковой проводимости, нарушениями функции печени и почек умеренной степени (клиренс креатинина не менее 10 мл/мин), нарушением функции дыхания, эпилепсией, после операций на сердце, при генетической склонности к злокачественной гипертермии, ослабленным больным и пациентам пожилого возраста.

При внутримышечном введении лидокаина может повыситься концентрация креатинина, что может привести к ошибке при постановке диагноза острого инфаркта миокарда.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с другими механизмами. После применения препарата не рекомендуется заниматься деятельностью, которая требует скорости психомоторных реакций.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий. При комбинированном применении лидокаина с такими препаратами, как *хлорпромазин, петидин, бупивакаин, хинидин, дизопирамид, имипрамин, нотриптилин*, концентрация лидокаина в плазме крови снижается.

Антиаритмические препараты (в т. ч. амиодарон, верапамил, хинидин, дизопирамид, аймалин) – усиливается кардиодепрессивное действие (происходит удлинение интервала QT и в единичных случаях возможно развитие AV-блокады или фибрилляции желудочков); одновременное применение с амиодароном может привести к развитию судорог.

Новокаин, новокаинамид, прокаинамид – возможно возбуждение ЦНС, бред, галлюцинации.

Курареподобные препараты – усиливается миорелаксация (возможен паралич дыхательных мышц).

Этанол усиливает подавляющее действие лидокаина на дыхание.

Вазоконстрикторы (эпинефрин, метоксамин, фенилефрин) способствуют замедлению всасывания лидокаина и пролонгируют действие последнего.

Циметидин снижает печеночный клиренс лидокаина (снижение в результате ингибирования микросомального окисления), повышает его концентрацию и риск развития токсичных эффектов.

Гуанадрель, гуанетидин, мекамиламин, триметафан – при комбинированном применении для спинальной и эпидуральной анестезии повышается риск выраженной артериальной гипотензии и брадикардии.

β-адреноблокаторы замедляют метаболизм лидокаина в печени, усиливают эффекты лидокаина (в т. ч. токсичные) и повышают риск развития брадикардии и артериальной гипотензии. При одновременном применении β-адреноблокаторов и лидокаина необходимо уменьшить дозу последнего.

Сердечные гликозиды – ослабляется кардиотонический эффект сердечных гликозидов.

Снотворные или седативные лекарственные средства – возможно усиление подавляющего действия на ЦНС снотворных и седативных препаратов.

Наркотические анальгетики (морфин и тому подобное) усиливается анальгезирующий эффект наркотических анальгетиков, угнетение дыхания.

Ингибиторы MAO (фуразолидон, прокарбазин, селегилин) – повышается риск развития артериальной гипотензии и пролонгируется местноанестезирующее действие последнего. В период лечения ингибиторами MAO не следует применять лидокаин парентерально.

Антикоагулянты (в т. ч. ардепарин, далтепарин, данапароид, эноксапарин, гепарин, варфарин и тому подобное) – увеличивают риск развития кровотечений.

Средства для наркоза – усиливается подавляющее действие на дыхательный центр средств для наркоза (гексобарбитал, тиопентал натрия внутривенно).

Полимиксин В – необходим контроль функции дыхания.

Рифампицин – возможно снижение концентрации последнего в крови.

Пропафенон – возможно увеличение длительности и повышение тяжести побочных эффектов со стороны ЦНС.

Прениламин – повышается риск развития желудочковой аритмии типа «пируэт».

Противосудорожные средства, барбитураты (фенобарбитал) – возможно ускорение метаболизма лидокаина в печени, снижение концентрации в крови, усиление кардиодепрессивного эффекта.

Изадрин, глюкагон – повышается клиренс лидокаина.

Норэпинефрин, мексилетин – снижается клиренс лидокаина (усиливается токсичность); уменьшается печеночный кровоток.

Ацетазоламид, тиазидные и петлевые диуретики уменьшают эффект лидокаина в результате создания гипокалимии.

Мидазолам – повышается концентрация лидокаина в плазме крови.

Препараты, которые предопределяют блокаду нервно-мышечной передачи – усиливается действие этих препаратов, поскольку они уменьшают проводимость нервных импульсов.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика. Производное ацетаниламида. Местноанестезирующее средство, которое оказывает терминальную, инфильтрационную, проводниковую анестезии. Относительная токсичность лидокаина гидрохлорида зависит от концентрации раствора. В малых концентрациях (0,5 %) он существенно не отличается по токсичности от новокаина, с увеличением концентрации (1 % и 2 %) токсичность повышается (40-50 %).

Фармакокинетика. При местном применении на слизистых оболочках лидокаин всасывается в разной степени, в зависимости от дозы и места нанесения (C_{max} достигается через 10-20 минут); на всасывание влияет скорость перфузии в слизистую оболочку. При внутримышечном введении C_{max} достигается через 5-15 минут. Связывание с белками плазмы крови – 60-80 % (в зависимости от дозы). Легко проходит через гистогематические барьеры, включая гематоэнцефалический. Сначала поступает в ткани с хорошим кровоснабжением (сердце, легкие, мозг, печень, селезенка), потом – в жировую и мышечную ткани. Проникает через плаценту, в организме новорожденного оказывается 40-55 % концентрации препарата, примененного роженице.

Метаболизируется на 90 % в печени путем окислительного N-деалкилирования с образованием активных метаболитов: моноэтилглицинксилидина и глицинксилидина, $T_{1/2}$ которых составляют 2 часа и 10 часов соответственно. Имеет эффект «первого прохождения».

При нарушении функции печени $T_{1/2}$ может возрасти более чем в 2 раза. В неизменном виде с мочой выводится 5-20 %.

Фармацевтические характеристики.

Основные физико-химические свойства: прозрачная, бесцветная или слегка окрашенная жидкость.

Несовместимость. Препарат не следует смешивать с другими лекарственными средствами в одном шприце. Лидокаин выпадает в осадок при смешивании с амфотерицином, метогеситоном или сульфадиазином. В зависимости от pH раствора лидокаин может быть несовместим с ампициллином.

Срок годности. 2 года.

Условия хранения. Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка. Ампулы по 2 мл, по 10 ампул в картонной пачке с перегородками или по 5 ампул в одностороннем блистере, по 2 блистера в пачке.

Категория отпуска. По рецепту.

Производитель. АО «Лекхим-Харьков».

Местонахождение. 61115, Украина, г. Харьков, ул. 17-го Партсъезда, 36.

Дата последнего пересмотра.